## 权 利 要 求 书

1、一种取代唑类化合物,如通式(I)所示:

$$R_5$$
 $A_2$ 
 $A_3$ 
 $A_4$ 
 $A_1$ 
 $R_6$ 
 $N$ 
 $X_3$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_2$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_1$ 
 $Q$ 
 $X_2$ 

5 式中:

10

X<sub>1</sub>选自CH或N, X<sub>2</sub>选自O、S或NR<sub>7</sub>, X<sub>3</sub>选自O、S或NR<sub>8</sub>;

 $A_1$  选自 N 或  $CR_9$ ,  $A_2$  选自 N 或  $CR_{10}$ ,  $A_3$  选自 N 或  $CR_{11}$ , 其中  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  同时选自 N 的个数小于、等于 1;

(I);

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>可相同或不同,分别选自氢、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基或卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基;

R<sub>3</sub>选自氢、卤原子、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基:

R7选自氢或 C1-C12烷基;

 $R_8$ 选自氢、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_{12}$ 烷基;

R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>可相同或不同,分别选自氢、卤原子、硝基、氰基、CONH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CN、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、可任意取代的下列基团: 胺基C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、芳基、杂芳基、芳氧基、芳基 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、芳 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基氧基、杂芳基 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基或杂芳基 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基;

20 及其立体异构体。

2、根据权利要求1所述的化合物,其特征在于:通式(1)中

X<sub>1</sub>选自CH或N, X<sub>2</sub>选自O、S或NR<sub>7</sub>, X<sub>3</sub>选自O、S或NR<sub>8</sub>:

 $A_1$  选自 N 或  $CR_9$ , $A_2$  选自 N 或  $CR_{10}$ , $A_3$  选自 N 或  $CR_{11}$ ,其中  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  同时选自 N 的个数小于、等于 1;

25  $R_1$ 、 $R_2$  可相同或不同,分别选自氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基或卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基;

 $R_3$ 选自氢、卤原子、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基或  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基;

R7选自氢或 C1-C6烷基:

 $R_8$ 选自氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基或  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_6$ 烷基;  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$  可相同或不同,分别选自氢、卤原子、硝基、氰基、CONH<sub>2</sub>、

WO 2005/080344 PCT/CN2005/000195

 $CH_2CONH_2$ 、 $CH_2CN$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_6$ 烷基、可任意取代的下列基团:胺基  $C_1$ - $C_6$ 烷基、芳基、杂芳基、芳氧基、芳基  $C_1$ - $C_6$ 烷基、芳  $C_1$ - $C_6$ 烷基、  $C_1$ - $C_6$ 烷基或杂芳基  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基。

3、根据权利要求2所述的化合物,其特征在于:通式(1)中

X<sub>1</sub>选自CH或N, X<sub>2</sub>选自O或NH, X<sub>3</sub>选自O、S或NR<sub>8</sub>;

 $A_1$  选自 N 或  $CR_9$ ,  $A_2$  选自 N 或  $CR_{10}$ ,  $A_3$  选自 N 或  $CR_{11}$ , 其中  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  同时选自 N 的个数小于、等于 1;

 $R_1$ 、 $R_2$ 选自甲基;

5

10

30

R3选自氢或甲基:

 $R_8$ 选自氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基基羰基或  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_3$ 烷基;  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$  可相同或不同,分别选自氢、卤原子、硝基、氰基、 $CONH_2$ 、 $CH_1$   $CONH_2$   $CH_2$   $CH_3$   $CH_4$   $CH_4$   $CH_5$   $CH_5$   $CH_5$   $CH_5$   $CH_6$   $CH_6$  C

 $CH_2CONH_2$ 、 $CH_2CN$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基  $C_1$ - $C_6$ 烷基  $C_1$ - $C_6$ 烷  $C_1$ - $C_6$ 0٪  $C_1$ - $C_6$ 0٪  $C_1$ - $C_6$ 0٪  $C_1$ - $C_6$ 0٪  $C_1$ - $C_1$ 

4、根据权利要求 3 所述的化合物, 其特征在于: 通式(I)中

 $X_1$ 选自CH或N,  $X_2$ 选自O或NH,  $X_3$ 选自O或NR<sub>8</sub>;

20 A<sub>1</sub>选自 N 或 CR<sub>9</sub>, A<sub>2</sub>选自 N 或 CR<sub>10</sub>, A<sub>3</sub>选自 N 或 CR<sub>11</sub>, 其中 A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>同时选自 N 的个数小于、等于 1;

 $R_1$ 、 $R_2$ 选自甲基;

R3选自氢:

R<sub>8</sub>选自氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基羰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基羰基 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基; R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub> 可相同或不同,分别选自氢、氯、溴、氟、硝基、氰基、CH<sub>2</sub>CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、卤代 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、取代胺基 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、苯基或取代苯基、苯氧基或取代苯氧基。

5、根据权利要求 4 所述的化合物, 其特征在于: 通式(I)中

 $X_1$ 选自CH或N, $X_2$ 选自O或NH,  $X_3$ 选自O或NR $_8$ ;

 $A_1$  选自 N 或  $CR_9$ ,  $A_2$  选自 N 或  $CR_{10}$ ,  $A_3$  选自 N 或  $CR_{11}$ , 其中  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  同时选自 N 的个数小于、等于 1;

 $R_1$ 、 $R_2$ 选自甲基:

R3选自氢;

35  $R_8$ 选自氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、卤代  $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基羰基或  $C_1$ - $C_3$ 烷氧基羰基  $C_1$ - $C_3$ 烷基;

WO 2005/080344 PCT/CN2005/000195

 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$  可相同或不同,分别选自氢、氯、溴、氟、硝基、氰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$  烷基、卤代  $C_1$ - $C_6$  烷氧基、卤代  $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基  $C_1$ - $C_6$  烷基  $C_1$ - $C_6$  烷基  $C_1$ - $C_6$  烷基  $C_1$ - $C_6$  烷氧基  $C_1$ - $C_6$  烷氧基  $C_1$ - $C_6$  烷氧基  $C_1$ - $C_6$  烷基  $C_1$ - $C_6$  烷氧基  $C_1$ - $C_6$  烷基  $C_1$ - $C_6$   $C_1$   $C_1$ - $C_1$ -

6、一种根据权利要求 1 所述取代唑类化合物的制备方法,其特征在于: 通式(I)化合物由通式(III) 所示的含羟基的唑类化合物与通式(IV) 所示的苄卤在碱性条件下反应制得:

$$\begin{array}{c} R_5 \\ A_2 \\ A_3 \\ A_1 \\ R_6 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_5 \\ R_4 \\ O \\ R_1 \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_5 \\ A_2 \\ A_3 \\ A_1 \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_4 \\ A_1 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ R_4 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ R_4 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ R_4 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ R_4 \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ R_4 \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ N \\ N \\ N \\ N \\ N \end{array} \begin{array}{c} R_3 \\ N \\ N \\$$

通式(IV)中,R是离去基团为氯或溴。

5

7、一种杀菌杀虫组合物,其特征在于:活性组分为通式(I)的所述的取代唑类化合物;组 10 合物中的活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

8、一种根据权利要求1所述的取代唑类化合物在防治作物上病菌和害虫的应用。

9、一种根据权利要求7所述的杀菌杀虫组合物在防治作物上病菌和害虫的应用。